

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织  
国际局



(43) 国际公布日:

2005年6月16日(16.06.2005)

PCT

(10) 国际公布号:

WO 2005/054173 A1

(51) 国际分类<sup>7</sup>: C07C 69/013, A61K 31/35

(21) 国际申请号: PCT/CN2004/001370

(22) 国际申请日: 2004年11月29日(29.11.2004)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:  
2003101200308 2003年12月1日(01.12.2003) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 淮北市辉克药业有限公司(HUAIIBEI-HUIKE PHARMACEUTICAL, CO., LTD.) [CN/CN]; 中国安徽省淮北市惠黎路工商大厦六楼, Anhui 235000 (CN)。

(72) 发明人;及

(75) 发明人/申请人(仅对美国): 叶红平(YE, Hongping) [CN/CN]; 中国安徽省淮北市惠黎路工商大厦六楼, Anhui 235000 (CN)。孙萌(SUN, Meng) [US/US]; 美国圣迭哥绍棒街13718号, CA 92128 (US)。

(74) 代理人: 上海专利商标事务所(SHANGHAI PATENT & TRADEMARK LAW OFFICE); 中国上海市桂平路435号徐迅, Shanghai 200233 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护):  
AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护):  
ARIPQ(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW); 欧亚专利(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM); 欧洲专利(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR); OAPI(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

本国际公布:  
— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title: HUVASTATIN AND ITS PREPARATION AND FORMULATION COMPRISING THE HUVASTATIN

(54) 发明名称: 辉伐他汀及其合成方法和以辉伐他汀为原料药的制剂

(57) Abstract: The invention relates to statin compounds, and it discloses novel small molecule compounds, i.e., huvastatin, which are classified into I, II, III. The invention also provides the production methods thereof and the formulations comprising the huvastatin as active components. The present compounds can be used at a lower dosage with respect to the existing statin compounds, and also can help to obtain the desired lipid levels of the patents with hyperlipidemia. Huvastatin of the invention has suitable hydrophilicity, stronger potency to reduce lipid levels, good medical effect and lower dose usage.

(57) 摘要

本发明涉及他汀类化合物, 公开了一种新型小分子他汀类化合物即辉伐他汀, 其分为第一、二、三类, 并提供了合成方法和以辉伐他汀为原料药的制剂, 解决了现有他汀类化合物用药量相对较高、高血脂症患者的脂质水平不能达到控制指标的问题。本发明的辉伐他汀具有较合适的亲水性, 降低血脂效力更强, 有更好的疗效和较低的用药量。